

A3

(19)



JAPANESE PATENT OFFICE

PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11) Publication number: **01117815 A**(43) Date of publication of application: **10.05.89**

(51) Int. Cl.

A61K 7/00
A61K 7/48(21) Application number: **62274407**(22) Date of filing: **29.10.87**(71) Applicant: **POLA CHEM IND INC**(72) Inventor: **MATSUMOTO KATSUO**
SATO MASAHIRO
OOKOUCHI YUMIKO(54) **EXTERNAL PREPARATION FOR SKIN**

(57) Abstract:

PURPOSE: To obtain an external preparation for the skin, providing the skin with moisture, improving physiological function of skin, extremely increasing smoothness and elasticity of skin, containing an extract of ZIZYPHI FRUCTUS, amino sugar (derivative) and uronic acid.

CONSTITUTION: An external preparation for the skin containing (A) an extract of ZIZYPHI FRUCTUS obtained

by removing a phototoxic substance from jujube of the family Rhamnaceae or fruit of a plant of the same genus, (B) an amino sugar (e.g., glucosamine or galactosamine) and/or amino sugar derivative (e.g., N-alkyl derivative) and further (C) uronic acid such as glucuronic acid or galacturonic acid as essential components. The blending ratio of each component is preferably 0.05W5wt.% (extract) or 0.005W1wt.% (powder) component A, 0.001W1wt.% component B and 0.001W1wt.% component C.

COPYRIGHT: (C)1989,JPO&Japio

⑬ 日本国特許庁(JP)

⑭ 特許出願公開

⑯ 公開特許公報(A)

平1-117815

⑮ Int. Cl.⁴

A 61 K 7/00

7/48

識別記号

庁内整理番号

K-7306-4C

F-7306-4C

6971-4C

⑰ 公開 平成1年(1989)5月10日

審査請求 未請求 発明の数 1 (全5頁)

⑱ 発明の名称 皮膚外用剤

⑲ 特 願 昭62-274407

⑳ 出 願 昭62(1987)10月29日

㉑ 発 明 者 松 本 克 夫 神奈川県横浜市神奈川区高島台27番地1 ポーラ化成工業株式会社横浜研究所内
㉒ 発 明 者 佐 藤 政 博 神奈川県横浜市神奈川区高島台27番地1 ポーラ化成工業株式会社横浜研究所内
㉓ 発 明 者 大 高 知 由 美 子 神奈川県横浜市神奈川区高島台27番地1 ポーラ化成工業株式会社横浜研究所内
㉔ 出 願 人 ポーラ化成工業株式会社 静岡県静岡市弥生町648番地

明 細 書

1. 発明の名称

皮膚外用剤

2. 特許請求の範囲

タイソウ抽出物と、アミノ糖及び／又はアミノ糖誘導体、更にウロン酸を必須成分として含有することを特徴とする皮膚外用剤。

3. 発明の詳細な説明

〔産業上の利用分野〕

本発明はタイソウ抽出物と、アミノ糖及び／又はアミノ糖誘導体、更にウロン酸を必須成分として含有することにより皮膚に潤いを与え、皮膚の生理機能を向上させ、皮膚の柔軟性、弾力性を著しく改善する皮膚外用剤に関するものである。

〔従来技術と問題点〕

皮膚老化現象のひとつとして、皮膚中のグリコサミノグリカンが加齢とともに減少することが知られている。このグリコサミノグリカン(特にヒアルロン酸)が減少するため皮膚組織は柔軟性、弾力性、保水性を失い、シワ、乾燥感等の症状が

生ずると思われる。これらの症状を改善するために、これまでの化粧品では、皮膚に不足するグリコサミノグリカンを配合し、中でも強い保水性を持つヒアルロン酸により、皮膚を潤かにし、適度な潤いを与えようとした。(特公昭33-500号)しかし、このような外部からの保水成分の補足では効果に限界があるため、皮膚内部に働き掛け、保水成分であるグリコサミノグリカンの合成を高め、皮膚全体の保水性を向上させようとして生体活性物質を配合する化粧品が見受けられる。(特公昭59-25311号、エストロゲンとグリコサミノグリカン配合)(特公昭60-252405号、ビタミンAとグリコサミノグリカン配合)

しかし、外部から補充したグリコサミノグリカンは、洗顔、汗等により簡単に洗い流されてしまい、グリコサミノグリカンのみを配合した化粧品では一時的な保水効果しか期待できない。また、エストロゲン、ビタミンAは皮膚内部へ作用し、グリコサミノグリカンの合成を促進する可能性があるがエストロゲンは真皮に対する効果が大部分

で、皮膚表面のツヤ、滑かさの改善効果は期待できない。また、ビタミンAは表皮に対する効果が大部分であるため、肌のハリに関与すると思われる真皮状態の改善効果は期待できない。

これらのことから、従来技術では、表皮、真皮をすべて含む皮膚全体の保水性、肌のハリ、滑かさの向上という重要な事柄についての効果が十分になされていなかった。

〔問題点を解決する手段〕

本発明者等は、生薬の薬効効果を研究していたところ、タイソウ抽出物に皮膚全体のグリコサミノグリカン合成促進効果があることを見出し、更にはアミノ糖及び／又はアミノ糖誘導体とウロン酸を共存させることにより、皮膚全体のグリコサミノグリカンの生合成を相乗的に高め、皮膚のシワ、乾燥感を解消、改善する効果を示すことを見出し、本発明を完成させるに至った。

すなわち、本発明は、タイソウ抽出物と、アミノ糖及び／又はアミノ糖誘導体、更にウロン酸を必須成分として含有することにより皮膚全体のグ

リコサミノグリカンの生合成を促進し、皮膚に潤いを与え、柔軟性及び保水性を高め、シワ、乾燥感等の皮膚老化現象を防ぐために効果的な皮膚外用剤を提供せんとするものである。以下本発明を詳細に述べる。

本発明で用いるタイソウ抽出物は、クロウメモドキ科植物の果実「ナツメ」又はナツメ果実及び同属植物の果実からなる「タイソウ」のエタノール抽出物から光毒性物質を除去したもので、タイソウリキド（一丸ファルコス社）として知られている（特公昭59-93011号）。このタイソウ抽出物の配合は、上記エタノール抽出物そのもの、或は減圧下でエタノール留去後、粉末としたもので行ない、配合量はエタノール抽出物の場合0.001～10重量%、粉末の場合0.0001～5重量%であるが、好ましくはエタノール抽出物の場合0.05～5重量%、粉末の場合0.005～1重量%である。

また、本発明で用いるアミノ糖及び／又はアミノ糖誘導体は、グルコサミン、ガラクトサミン等のヘキソサミンを指し、誘導体としては、N-ア

セチルグルコサミン、N-アセチルガラクトサミン等のN-アルキル誘導体を指し、更には、UDP-N-アセチルグルコサミン、UDP-N-アセチルガラクトサミン等の核酸誘導体も含まれる。これらの中から一種又は二種以上の組合せで配合し、配合量は0.0001～5重量%で、好ましくは、0.001～1重量%である。

更に本発明で用いるウロン酸は、グルクロン酸、ガラクトン酸、イズロン酸等のヘクスロン酸及びその塩類であり、配合量は0.0001～5重量%であるが、好ましくは0.001～1重量%である。

加えて、皮膚組織内では、グルコース等のヘキソースをヘキソサミン、ヘクスロン酸にまで変換する機構があるため、ヘキソースの配合も可能であるが前述のアミノ糖及び／又はアミノ糖誘導体、ウロン酸を配合する方がよい。

本発明の皮膚外用剤は、前述の必須成分に加えて本発明の効果を損なわない範囲で、化粧品、医薬品等に用いられる各種成分すなわち、水分、油分、界面活性剤、保湿剤、防腐剤、香料等を用い

ることができる。加えて、この発明の効果を補足する意味でグリコサミノグリカン誘化剤料中に、0.01～10%の範囲で配合することもできる。ここでいうグリコサミノグリカンとは、たとえばヒアルロン酸、コンドロイチン硫酸A、B、C、ヘパラン硫酸等またはその塩類である。

これらの成分を組成物として皮膚外用剤に用いる場合、ローション等の可溶化系、クリーム、乳液等の乳化系、軟膏、分散液、粉末製品等の任意な剤型をとることができる。

〔実施例〕

以下、実施例により本発明及び本発明の効果について述べる。処方例中の数字は重量%である。

(処方1) 栄養クリーム

		実施例1	実施例2	比較例
A	セチルアルコール	3.0	3.0	3.0
	ゲイロウ	3.0	3.0	3.0
	スクワラン	20.0	20.0	20.0
	モノステアリン酸	1.6	1.6	1.6
	ソルビタン			
	ポリオキシエチレン	2.4	2.4	2.4
B	モノステアリン酸			
	ソルビタン(20E0)			
	グリセリン	10.0	10.0	10.0
B	エチルパラベン	0.2	0.2	0.2
	精製水	20.0	20.0	20.0
C	タイソウ抽出物 (粉末)	1.0	1.0	—
	アミノ酸	—	0.5	—
	ウロン酸	—	0.5	—
	香料	適量	適量	適量
	精製水	残量	残量	残量

製法：上記処方物Aを混合加熱して75℃とし、これに上記処方物Bを同様に混合加熱して75℃としたものを加え、ホモミキサーで均一に乳化し、冷却して常温付近になったところで上記処方物Cを加え、再び冷却して製品とする。

(使用テスト)

本発明の作用効果について、使用テストにて試験を行なった。パネラーには乾燥肌、荒れ肌の女性52名を募り、26名ずつ2群に分け、右の甲全体に実施例1または2を、左の甲全体に比較例をそれぞれ1日3回通常の使用方法で塗布し、50日間連用試験とした。実施期間は乾燥感を生じ易い1月から2月にかけて行ない、改善効果の判定は25日目と50日目に行なった。判定方法は比較例に比べて実施例のほうが、どの程度改善効果を示したかを、下表の基準に基づき申告してもらう方法をとった。

(結果) 実施例1

	25日目	50日目
非常に改善された	3名	9名
少し改善された	8	6
どちらともいえない	15	10
少し悪化した	0	1
非常に悪化した	0	0
計	26名	26名

実施例2

	25日目	50日目
非常に改善された	10名	17名
少し改善された	5	3
どちらともいえない	10	5
少し悪化した	1	1
非常に悪化した	0	0
計	26名	26名

この結果により、本発明が乾燥肌、荒れ肌の改善に優れた効果を有することが示される。

(処方2) エッセンスローション

		実施例1	実施例2	比較例
A	グリセリン	2.0	2.0	2.0
	1,3ブチレン	11.0	11.0	11.0
	グリコール			
	ポリオキシ	0.7	0.7	0.7
	エチレン硬化			
	ヒマシ油(50E0)			
B	香料	適量	適量	適量
	クエン酸	0.1	0.1	0.1
	クエン酸	0.2	0.2	0.2
	ナトリウム			
	メチルパラベン	0.1	0.1	0.1
	ヒアルロン酸	0.1	0.1	0.1
	タイソウ抽出物	5.0	5.0	5.0
	アミノ酸	—	0.5	—
	ウロン酸	—	0.5	—
	精製水	残量	残量	残量

製法：上記処方物AおよびBを加温溶解し、BにAを加えて可溶化し製品とする。

(使用テスト)

本発明のエッセンスローションの作用効果につき、使用テストにて試験を行なった。使用テストは、36名の女性パネラーを募り、12名づつ3群にわけ、1群には比較例を、他の2群には実施例をあて、1日2回、朝の洗顔後と夜の就寝前に通常の方法で顔面に塗布してもらい、30日間の運用試験を行なった。

運用試験前にパネラー全員の顔面皮膚状態の官能評価表を作成し、30日間の運用試験後に改めて官能評価を行ない30日間の変化を評価した。ここでは、評価項目中、「肌の弾力性、適度なハリの向上」、「肌のしっとり感の向上」についての結果を示す。

(結果)

	実施例1	実施例2	比較例
肌の弾力性、 適度なハリの向上	6/12	11/12	3/12
肌のしっとり感の向上	8/12	11/12	5/12

この結果により本発明で、肌の弾力性、ハリを取り戻し、しっとりした状態を提供できることが示された。

更に処方例を示す。

(処方3) エモリエントクリーム

A	セタノール	2.0
	ゲイロウ	5.0
	スクワラン	7.0
	オリーブ油	24.0
	ステアリン酸	6.0
	モノステアリン酸ソルビタン	4.0
	ポリオキシエチレンモノステアリン酸ソルビタン(20EO)	4.0
B	プロピレングリコール	3.5
	エチルパラベン	0.1
	精製水	30.0
C	タイソウ抽出物(粉末)	3.0
	アミノ糖	0.8
	ウロン酸	0.8
	香料	適量
	精製水	残量

製法：上記処方物Aを混合加熱して70℃とする。

これに上記処方物Bを同様に混合加熱して70℃としたものに加え、ホモミキサーで均一に乳化し、冷却し、常温になったところで上記Cを加えて再び冷却し、製品とする。

(処方4) 乳液

A	ミツロウ	1.0
	ワセリン	1.0
	セタノール	1.0
	ラノリン	3.0
	ステアリン酸	2.0
	流動パラフィン	7.0
	オリーブ油	3.0
	ソルビタンセスキオレイン酸エステル	0.8
	ポリオキシエチレンオレイルエーテル(10EO)	2.0

B	ヒアルロン酸	0.5
	グリセリン	4.0
	1,3 - アチレングリコール	4.0
	エタノール	5.0
	水酸化カリウム	0.1
	メチルパラベン	0.2
	精製水	30.0
C	タイソウ抽出物(粉末)	2.5
	アミノ糖	0.4
	ウロン酸	0.4
	香料	適量
	精製水	残量

製法：上記処方物Aを混合加熱して70℃とする。
これに上記処方物Bを同様に混合加熱して、
70℃としたものを加え、ホモミキサーで
均一に乳化し、冷却して常温になったところ
で上記Cを加えて再び冷却し、製品とする。

(処方5) 化粧水

A	エタノール	9.0
	グリセリン	5.0
	α - メントール	0.05
	ポリオキシエチレン硬化 ヒマシ油(50EO)	0.5
B	タイソウ抽出物	15.0
	アミノ糖	2.0
	ウロン酸	1.0
	香料	適量
	精製水	残量

製法：上記処方物A及び上記処方物Bを加熱溶解
し、BにAを加え、可溶化して製品とする。

特許出願人 ポーラ化成工業株式会社

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成7年(1995)4月11日

【公開番号】特開平1-117815

【公開日】平成1年(1989)5月10日

【年通号数】公開特許公報1-1179

【出願番号】特願昭62-274407

【国際特許分類第6版】

A61K 7/00 K 9051-4C

F 9051-4C

7/48 9051-4C

手続補正書

平成6年8月31日

特許庁長官

高島 章 殿

1. 事件の提示

昭和62年特許願第274407号

2. 発明の名称

皮膚外用剤

3. 補正をする者

事件との関係

特許出願人

住所

静岡県静岡市葵区6番48号

名称

ポーラ化成工業株式会社

代表者

鈴木常司

4. 補正命令の日付

自発補正(出願審査請求書と同時に提出)

5. 補正の対象

明細書の「発明の詳細な説明」の欄

6. 補正の内容

(1) 明細書の発明の詳細な説明第2頁10~11行目に、「特公昭59-25311号」とあるのを「特開昭59-25311号」と補正する。

(2) 同第2頁12行目に、「特公昭60-252405号」とあるのを「特開昭60-252405号」と補正する。

(3) 同第4頁11行目に、「特公昭59-83011号」とあるのを「特開昭59-83011号」と補正する。

(4) 同第7頁を以下と差し替える。

「

(処方1) 栄養クリーム

		比較例 1	実施例 1	対照例 1
A	セチルアルコール	3.0	3.0	3.0
	グイロウ	3.0	3.0	3.0
	スクワラン	20.0	20.0	20.0
	モノステアリン酸 ソルビタン	1.6	1.6	1.6
	ポリオキシエチレン モノステアリン酸 ソルビタン (20E0)	2.4	2.4	2.4
B	グリセリン	10.0	10.0	10.0
	エチルパラベン	0.2	0.2	0.2
	精製水	20.0	20.0	20.0
C	タイソウ抽出物 (粉末)	1.0	1.0	—
	アミノ酸	—	0.5	—
	ウロン酸	—	0.5	—
	香料	適量	適量	適量
	精製水	残量	残量	残量

(5) 同第8頁下から8行目に、「全体に実施例1または2を、左の甲全体に比較例」とあるのを「全体に比較例1または実施例1を、左の甲全体に対照例1」

と補正する。

(6) 同第8頁下から3行目に、「比較例に比べて実施例のほうが」とあるのを「対照例に比べて比較例または実施例のほうが」と補正する。

(7) 同第9頁を以下と差し替える。

「

(結果) 比較例1

	25日目	50日目
非常に改善された	3名	8名
少し改善された	8	6
どちらともいえない	15	10
少し悪化した	0	1
非常に悪化した	0	0
計	26名	26名

実施例1

	25日目	50日目
非常に改善された	10名	17名
少し改善された	5	3
どちらともいえない	10	5
少し悪化した	1	1
非常に悪化した	0	0
計	26名	26名

施例を与え」とあるのを「1群には対照例2を、他の2群には比較例2または実施例2を与え」と補正する。

(10) 同第12頁を以下に差し替える。

「

(結果)

	比較例2	実施例2	対照例2
肌の弾力性、適度なハリの向上	6/12	11/12	3/12
肌のしっとり感の向上	8/12	11/12	5/12

この結果により本発明で、肌の弾力性、ハリを取り戻し、しっとりした状態を提供できることが示された。

更に処方例を示す。

(11) 同第13頁1行目の後に、改行して以下の1行を追加する。

「

実施例3

(12) 同第14頁8行目の後に、改行して以下の1行を追加する。

「

実施例4

(13) 同第16頁1行目の後に、改行して以下の1行を追加する。

「

実施例5

この結果により、本発明が乾燥肌、荒れ肌の改善に優れた効果を有することが示される。

(8) 同第10頁を以下と差し替える。

「

(処方2) エッセンスローション

		比較例 2	実施例 2	対照例 2
A	グリセリン	2.0	3.0	3.0
	1.3 ブチレン	11.0	3.0	3.0
	グリコール			
	ポリオキシ	0.7	0.7	0.7
	エチレン酸化 ヒマシ油 (50EO)			
	香料	適量	適量	適量
B	クエン酸	0.1	0.1	0.1
	クエン酸ナトリウム	0.2	0.2	0.2
	メチルパラベン	0.1	0.1	0.1
	ヒアルロン酸	0.1	0.1	0.1
	タイソウ抽出物	5.0	5.0	—
	アミノ酸	—	0.5	—
	ウロン酸	—	0.5	—
	精製水	残量	残量	残量

(9) 同第11頁下から10～8行目に、「1群には比較例を、他の2群には実